HELLER EHRMAN WHITE & McAULIFFE LLP (Sheet -1- of 11) THE EROCYCLIC MODULATORS OF NUCLEAR RECEPTORS

Applicants: Martin et al.
Filed: November 18, 2003
Atty Docket No.: 38205-3001B

EXAMPLE	EC50_AVG	EFF_AVG	IC50_AVG	INHIB_AVG
1	D	С		
2	D	С		
3	D	С		
4	D	В	-	
5	C	В		
6	D	С		
7	. D	D		
8	C	В		
9	С	В		
10	С	С		
11	В	В		
12	С	С		
13	С	В		
14	D	С		
15	С	С		
16	С	Α		
17	С	С		
18	С	С		
19	С	D		
20	D	С		
21	С	В		
22	В	В		
23	С	С		
24	D	С		
25	D	С		
26	С	В		
27	С	В		

FIG. 1A

HELLER EHRMAN WHITE & McAULIFFE LLP (Sheet -2- of 11) TIME TEROCYCLIC MODULATORS OF NUCLEAR RECEPTORS

28	D	С		
29	С	В		
30	С	Α		
31	В	В		
32	В	В		NEG
32	В	В		
32	Α	В		
33	В	В		
34	С	С		
35	С	В		
36	В	Α		
37	D	В		
38	Α	Α		
39	NC	NC		
40	NC	NC		
41	NC	NC		
42	NC	NC		
43	D	D		
44	D	D		
45	D	D		
46	NC	NC		
47	С	С	С	F
48	С	С	В	F
49	С	С	С	F
50	D	С		G
51	NC	D	·	
52	В	D	В	F
55	Α	Α		

FIG. 1B

ELLER EHRMAN WHITE & McAULIFFE LLP (Sheet -3- of 11) HETEROCYCLIC MODULATORS OF

NUCLEAR RECEPTORS

Applicants: Martin et al. Filed: November 18, 2003 Atty Docket No.: 38205-3001B

56	Α	Α		
57	В	В		
58	В	D	Α	F
59	В	С		
60	NC	NC	В	E
61	D	С		NEG
62	С	D		
63	С	С		
64	С	В		
65	С	С		
66	В	С		
67	С	Α		
68	D	С		
69	С	С		
70	NC	NC		
71	С	В		
72	С	С		
73	С	В		
74	С	С		
75	D	С		
76	NC	NC		
77	NC	NC		
78	С	Α		
79	С	В		
80	С	В		
81	В	В		
82	В	В		
82	В	В		

FIG. 1C

HELLER EHRMAN WHITE & McAULIFFE LLP (Sheet -4- of 11) TEROCYCLIC MODULATORS OF NUCLEAR RECEPTORS

83	В	Α		
84	В	В		
85	В	В		
86	С	В		
87	Α	. А		
88	NC	NC		
89	D	D		
90	В	В		
91	В	В		NEG
91	В	В		NEG
92	В	В		Н
93	С	В		NEG
94	В	С		NEG
95	D	В		NEG
96	В	С	С	G
97	В	В		NEG
98	С	В		Н
99	В	В		NEG
100	В	С		Н
101	В	В		NEG
102	С	В		Н
103	В	В	D	Н
104	NC	NC		
105	С	С		
106	С	D		
107	NC .	NC		
108	В	С		
109	С	С		

FIG. 1D

HELLER EHRMAN WHITE & McAULIFFE LLP (Sheet -5- of 11) TETEROCYCLIC MODULATORS OF

NUCLEAR RECEPTORS
Applicants: Martin et al.

Filed: November 18, 2003 Atty Docket No.: 38205-3001B

110	С	С	
112	NC	NC	
113	С	С	
114	С	В	
115	С	С	
116	D	В	
117	С	С	Н
118	С	В	NEG
119	С	С	Н
120	С	С	Н
121	С	В	NEG
122	С	С	Н
123	С	C	Н
124	С	D	Н
125	С	D	G
126	С	С	NEG
127	NC	NC	Н
128	С	В	NEG
129	В	В	NEG
130	В	В	NEG
131	В	С	NEG
132	С	С	NEG
133	D	D	NEG
134	В	В	NEG
135	Α	С	н
136	В	В	NEG
137	В	В	NEG
138	В	В	NEG

FIG. 1E

HELLER EHRMAN WHITE & McAULIFFE LLP (Sheet -6- of 11) ETEROCYCLIC MODULATORS OF NUCLEAR RECEPTORS

В	В		NEG
С	В		н
С	В		NEG
В	Α		NEG
В	С		G
С	С	D	E
Α	С	D	F
В	D	В	E
Α	Α		Н
NC	D		G
В	D	С	E
Α	В		
В	В		
Α	В		G
В	В		
NC	NC	С	F
NC	NC		
NC	D		
В	В		
В	С		
В	D	Α	F
С	D	В	F
В	D	В	F
В	С	В	F
В	D	A	F
В	D	В	F
С	D		G
NC	D		·
	C C B B C A B A B A B NC NC NC B B B B C C B B B C C	C B B C B B A B C C C A C B A NC D B B B B NC NC NC NC NC D B B B C B C D C D C D C D C D C D C	C B C B B A B A B C C C D A C D B B A A NC D B B C A B B B C A B B B C NC NC C NC NC NC D B B B B B C B C

FIG. 1F

HE SR EHRMAN WHITE & McAULIFFE LLP (Sheet -7- of 11) Title: TEROCYCLIC MODULATORS OF NUCLEAR RECEPTORS

Applicants: Martin et al. Filed: November 18, 2003 Atty Docket No.: 38205-3001B

167	С	С		
168	В	В		
169	С	В		
170	С	В		
171	С	Α		
172	С	Α		
173	С	Α		
174	С	С		
175	С	В		
176	В	В		
177	NC	NC	В	Ε
178	D	С	С	G
179	В	Α		
180	С	D		
181	D	С		
182	С	В		
183	С	D	D	G
184	С	В		NEG
185	С	С		Н
186	В	В		NEG
187	NC	D		Н
188	D	D	Α	G
189	С	D	С	F
190	С	В		NEG
191	С	В		Н
192	С	D	С	Ε
193	С	С	D	G
194	С	С		Н

FIG. 1G

LLER EHRMAN WHITE & McAULIFFE LLP (Sheet -8- of 11) HETEROCYCLIC MODULATORS OF

NUCLEAR RECEPTORS

Applicants: Martin et al. Filed: November 18, 2003 Atty Docket No.: 38205-3001B

195	С	С		Н
196	D	D	С	G
197	В	D	В	F
198	С	D	С	E
199	С	D	В	F
200	С	D	В	F
201	С	С		н
202	D	С		н
203	С	С		н
204	С	D	В	F
205	NC	D		NEG
206	В	Α		NEG
207	С	С		NEG
208	С	В		NEG
209	С	В		NEG
210	С	В		NEG
211	В	В		NEG
212	С	С		н
213	D	D		Н
214	С	D	С	G
215	С	D	С	F
216	С	D	В	Ε
217	В	D	В	F
218	В	D	В	E
219	В	С	В	G
220	С	D	В	E
221	В	D	В	F
222	D	D	D	E

FIG. 1H

HELLER EHRMAN WHITE & McAULIFFE LLP (Sheet -9- of 11) HETEROCYCLIC MODULATORS OF NUCLEAR RECEPTORS

223	В	D	В	G
224	С	D	С	F
225	С	С		G
227	В	С		
228	С	В		
229	В	С .	В	G
230	D	В		
231	NC	NC	С	E
232	В	С		G
233	С	D		G
234	В	D	В	F
235	NC	NC		
236	D	С		
237	D	D		
238	D	D		-
239	NC	NC		
240	NC	NC		
241	NC	D		
241	NC	NC		
242	С	D		
242	NC	NC		
243	В	В		
244	С	Α		
244	Α	Α		
245	В	С		
246	NC	D		
247	С	С		
248	В	D	С	E

FIG. 11

HELLER EHRMAN WHITE & McAULIFFE LLP

(Sheet -10- of 11) he: HETEROCYCLIC MODULATORS OF NUCLEAR RECEPTORS

Applicants: Martin et al. Filed: November 18, 2003 Atty Docket No.: 38205-3001B

248	В	D	С	E
249	С	С	Α	G
250	В	С		
251	С	С		
252	NC	D		
253	D	D		
254	С	D		
255	В	D	Α	E
256	D	D		
257	NC	NC	С	F
258	С	D	С	F
259	NC	NC	С	F
259	NC	NC	С	F
259	С	D	В	E
260	NC	NC	В	G
261	В	D	В	G
262	В	С	Α	Д
263	С	D	В	F
264	В	D	Α	F
265	В	В		
266	С	В		
267	В	В		
268	. В	D	Α	G
269	В	С		
270	В	В		Н
271	В	D	В	F
272	В	В		NEG
273	D	С		Н

FIG. 1J

LLER EHRMAN WHITE & McAULIFFE LLP (Sheet -11- of 11) Title: HETEROCYCLIC MODULATORS OF

274	В	D	В	E
275	Α	D		NEG
276	В	С		NEG
277	С	D		G
278	NC	NC		G
279	С	D	С	F
280	С	D	С	G
281	С	D		NEG
.282	С	D	С	E
283	NC	NC	С	E
284	NC	NC		H
285	NC	С	Α	G
286	В	С	Α	G
287	С	D	В	G
288	С	D	С	G
289	С	D		н
290	В	С		NEG

FIG. 1K